

СИНТЕЗ 5-АЦИЛ-ТЕТРАГИДРОПИРИМИДИН-2-ТИОНОВ

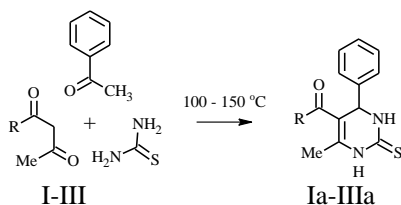
Лапшинова Е.А., Ширяев А.К.

Самарский государственный технический университет
443100, г. Самара, ул. Молодогвардейская, д. 244

Пиримидиновый структурный фрагмент входит в состав ряда природных соединений и химиотерапевтических препаратов. Производные тетрагидропиримидинов проявляют антигипертензивную и кардиоваскулярную активность, чем обусловлен значительный интерес к их синтезу в последние годы.

Одним из удобных методов получения 1,2,3,4-тетрагидропиримидин-2-тионов является трехкомпонентная конденсация Биджинелли. Классический вариант проведения реакции - кипячение реагентов в этаноле в присутствии каталитических количеств соляной кислоты. В настоящее время разработаны разнообразные варианты проведения реакции, включающие варьирование растворителей, катализаторов, температуры и методов нагревания.

Целью нашего исследования была разработка методов синтеза 5-ацил-1,2,3,4-тетрагидропиримидин-2-тионов.



R = CH₃ (I, Ia); R = Ph (II, IIa), R = 1-адамантил (III, IIIa)

5-Ацетил-1,2,3,4-тетрагидропиримидин-2-тион (Ia) был получен с хорошим выходом кипячением ацетилацетона (I), бензальдегида и тиомочевины в ацетонитриле в присутствии йода в качестве катализатора. Соответствующее 5-бензоилпроизводное (IIa) не удалось получить в этих условиях, и оно было синтезировано нагреванием бензоилацетона (II), бензальдегида и тиомочевины без растворителя и без катализатора при 100-110 °С. Конденсацию ацетилацетона в этих условиях провести не удалось, даже используя каталитическое количество серной или *n*-толуолсульфокислоты. Реакция (1-адамантоил)ацетона (III) с бензальдегидом и тиомочевинной не идет ни при одном из вышеприведенных условий. 5-Адамантоил-1,2,3,4-тетрагидропиримидин-2-тион (IIIa) был получен лишь путем нагревания реагентов в течение 3 ч при температу-

ре выше 140 °С. Адамантилсодержащий тетрагидропиримидин (III) получен впервые, и построенная модель молекулы демонстрирует, что 1-адамантанойльная группа может располагаться только перпендикулярно плоскости пиримидинового кольца вследствие отталкивания объемного 1-адамантильного заместителя от соседних групп.

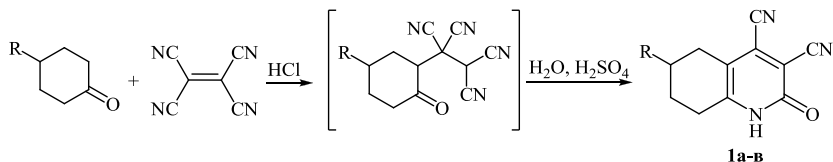
НОВЫЙ ПОДХОД К СИНТЕЗУ ЦИАНОЗАМЕЩЕННЫХ ГИДРИРОВАННЫХ ХИНОЛИНОВ

Липин К.В., Федосеев С.В.

Чувашский государственный университет
428015, г. Чебоксары, Московский пр., д. 15

Наиболее простой способ получения цианозамещенных гексагидрохинолинов – синтез из 4-оксоалкан-1,1,2,2-тетракарбонитрилов при помощи различных кислот [1-4]. Сами по себе данные гетероциклы являются удобными билдинг-блоками благодаря наличию многих реакционных центров и поэтому мы решили создать простой и более рациональный метод их получения.

По известной методике [3,4] искомые гексагидрохинолины получают путем взаимодействия 4-оксоалкан-1,1,2,2-тетракарбонитрилов с водой в присутствии серной кислоты в среде 1,4-диоксана. Исходные соединения для данного синтеза образуются в результате реакции тетрацианоэтилена с кетонами в присутствии каталитического количества соляной кислоты. В результате проведенных исследований обнаружено, что получение 2-оксо-1,2,5,6,7,8-гексагидрохинолин-3,4-дикарбонитрилов **1а-в** можно проводить одnoreакторно, без выделения 4-оксоалкан-1,1,2,2-тетракарбонитрилов.



R=H (а); R=CH₃ (б); R=*t*-Bu (в)

Структуры соединений **1а-в** подтверждены данными ИК, ¹H ЯМР спектроскопии и масс спектрометрии.

Таким образом, нами разработан простой и рациональный метод получения 2-оксо-1,2,5,6,7,8-гексагидрохинолин-3,4-дикарбонитрилов,